

化学药品溶出度方法实验研究初探 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E5_8C_96_E5_AD_A6_E8_8D_AF_E5_c23_17912.htm 溶出度 (Dissolution rate) 也称溶出速率，是指在规定的溶剂和条件下，药物从片剂、胶囊剂、颗粒剂等固体制剂中溶出的速度和程度。测定固体制剂溶出度的过程称为溶出度试验 (Dissolution test)，它是一种模拟口服固体制剂在胃肠道中的崩解和溶出的体外试验方法。药物溶出度检查是评价制剂品质和工艺水平的一种有效手段，可以在一定程度上反映主药的晶型、粒度、处方组成、辅料品种和性质、生产工艺等的差异，也是评价制剂活性成分生物利用度和制剂均匀度的一种有效标准，能有效区分同一种药物生物利用度的差异，因此是药品质量控制必检项目之一。一般认为，难溶性（一般指在水中微溶或不溶）药物，因制剂处方与生产工艺造成临床疗效不稳定的药物以及治疗量与中毒量相接近的药物（包括易溶性药物），其口服固体制剂质量标准中必须设定溶出度检查项。另外固体制剂的处方筛选及生产工艺流程制订过程中，也需对所开发剂型的溶出度做全面考察。一个可行的溶出度试验法应是在不同时间、地点对同一制剂的溶出度测定或不同的操作者之间的测定都必须达到试验结果具有良好的重现性。为了达到以上目的，必须对溶出度测定试验进行全面充分的研究。溶出度研究试验主要包括以下内容：（1）溶出介质的选择，（2）溶出介质体积的选择，（3）溶出方法（转篮法与桨法）的选择，（4）转速的选择，（5）溶出度测定方法的验证，（6）溶出度均一性试验（批内），（7）重现性试验（

批间)等。近来在新药审评中发现,部分研究单位在进行溶出度研究时存在一些问题,主要表现在溶出度研究资料过于简单或溶出度研究内容不够全面。现予以具体分析,希望能对溶出度研究有一定的帮助。

1、溶出介质的选择:通常情况下,溶出介质首选水,其次是0.1mol/L盐酸、缓冲液(pH值3~8)、人工胃液或人工肠液;若介质中加适量有机溶剂如异丙醇、乙醇或加分散助溶剂如十二烷基硫酸钠(0.5%以下)等,应有文献依据,并尽量选用低浓度,必要时应做生物利用度考察。通过测定药物在不同介质中的溶出曲线(通常应测定至药物全部溶出)来选择适宜的溶出介质。在一些申报资料中,仅简单地通过比较主药在各介质中的溶解度来选择溶出介质;还有一些品种在采用加有表面活性剂、有机溶剂或采用较高pH值的缓冲液为溶出介质时,没有提供充分的试验数据,难以说明介质选择的合理性。

100Test 下载频道开通,各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com